

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 11-043490

(43)Date of publication of application : 16.02.1999

(51)Int.Cl.

C07D495/10  
A61K 31/535  
A61K 31/535  
A61K 31/535  
A61K 31/535  
A61K 31/535  
// C07M 7:00

(21)Application number : 10-146881

(71)Applicant : SANKYO CO LTD

(22)Date of filing : 28.05.1998

(72)Inventor : NISHI TAKEHIDE  
YAMAGUCHI TAKESHI

(30)Priority

Priority number : 09141805

Priority date : 30.05.1997

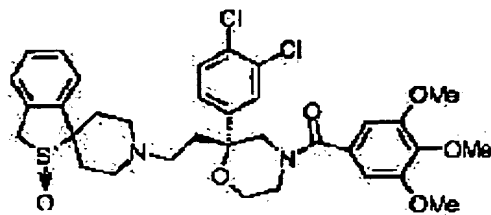
Priority country : JP

## (54) SALT OF OPTICALLY ACTIVE SULFOXIDE DERIVATIVE

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new compound, having an antagonistic activity for receptors of both substance P and neurokinin A and useful as prophylactic and therapeutic agents for tachykinin-mediated diseases.

SOLUTION: This compound is a hydrochloride or a fumarate of 1-[2-[(2 R)-(3,4-dichlorophenyl)-4-(3,4,5-trimethoxybenzoyl)morpholin-2-yl]ethyl]spiro-[benzo(c)thiophene-1(3H),4'-piperidine]-(2S)-oxide [a compound represented by the formula ( $\text{>S}^* \rightarrow \text{O}$  is a sulfoxide in which oxygen is combined with sulfur by the absolute configuration)]. The compound can be produced by converting the compound represented by the formula into the hydrochloride or the fumarate according to a well-known method. For example, psychosis, Alzheimer's disease, osteoarthritis, inflammatory intestinal disease, bronchitis, asthma, rhinitis, incontinence of urine and collagen disease are cited as tachykinin-mediated diseases.



## LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

05.06.2002

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than dismissal  
the examiner's decision of rejection or

application converted registration]

[Date of final disposal for application] 20.01.2006

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision  
of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's  
decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平 1 1 - 4 3 4 9 0

(43) 公開日 平成 11 年 (1999) 2 月 16 日

(51) Int. Cl.<sup>5</sup>

識別記号

F I

C 0 7 D 495/10

C 0 7 D 495/10

A 6 1 K 31/535

A 6 1 K 31/535

A B F

A B F

A B M

A B M

A C D

A C D

A C V

A C V

審査請求 未請求 請求項の数 1 5 O L

(全 1 4 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平 10-146881

(71) 出願人 000001856

(22) 出願日 平成 10 年 (1998) 5 月 28 日

三共株式会社

東京都中央区日本橋本町 3 丁目 5 番 1 号

(31) 優先権主張番号 特願平 9-141805

(72) 発明者 西 剛秀

東京都品川区広町 1 丁目 2 番 58 号 三共株式  
会社内

(32) 優先日 平 9 (1997) 5 月 30 日

(72) 発明者 山口 武

東京都品川区広町 1 丁目 2 番 58 号 三共株式  
会社内

(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(74) 代理人 弁理士 大野 彰夫 (外 2 名)

(54) 【発明の名称】 光学活性スルホキシド誘導体の塩

(57) 【要約】

【課題】 良好な経口吸収性を有し、N K<sub>1</sub> 受容体及び N K<sub>2</sub> 両受容体に対する格別な拮抗活性を有する化合物を提供する。

【解決手段】 1 - { 2 - [ ( 2 R ) - ( 3 , 4 - ジクロ  
ロフェニル ) - 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリメトキシベンゾ  
イル ) モルホリン - 2 - イル ] エチル } スピロ [ ベンゾ  
( c ) チオフェン - 1 ( 3 H ) , 4 ' - ピペリジン ] -  
( 2 S ) - オキシドの塩酸塩又はフマル酸塩。